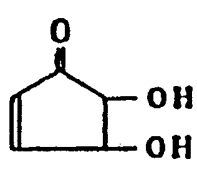


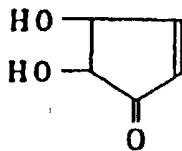


<p>(51) 国際特許分類6 C07C 49/707, 45/67, A01N 35/06, A23L 1/30, A61K 7/00, 7/50, 31/12</p>	<p>A1</p>	<p>(11) 国際公開番号 WO98/13328</p> <p>(43) 国際公開日 1998年4月2日(02.04.98)</p>															
<p>(21) 国際出願番号 PCT/JP97/03052</p> <p>(22) 国際出願日 1997年9月1日(01.09.97)</p> <p>(30) 優先権データ</p> <table border="0"> <tr> <td>特願平8/275231</td> <td>1996年9月27日(27.09.96)</td> <td>JP</td> </tr> <tr> <td>特願平8/325900</td> <td>1996年11月22日(22.11.96)</td> <td>JP</td> </tr> <tr> <td>特願平9/55434</td> <td>1997年2月25日(25.02.97)</td> <td>JP</td> </tr> <tr> <td>特願平9/92866</td> <td>1997年3月28日(28.03.97)</td> <td>JP</td> </tr> <tr> <td>特願平9/116045</td> <td>1997年4月21日(21.04.97)</td> <td>JP</td> </tr> </table> <p>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 寶酒造株式会社(TAKARA SHUZO CO., LTD.)(JP/JP) 〒612 京都府京都市伏見区竹中町609番地 Kyoto, (JP)</p> <p>(72) 発明者 ; および</p> <p>(75) 発明者 / 出願人 (米国についてのみ)</p> <p>小山信人(KOYAMA, Nobuto)(JP/JP)</p> <p>佐川裕章(SAGAWA, Hiroaki)(JP/JP)</p> <p>小林英二(KOBAYASHI, Eiji)(JP/JP)</p> <p>榎 竜嗣(ENOKI, Tatsuji)(JP/JP)</p> <p>務 華康(WU, Hua-Kang)(CN/JP)</p> <p>西山英治(NISHIYAMA, Eiji)(JP/JP)</p> <p>猪飼勝重(IKAI, Katsushige)(JP/JP)</p> <p>加藤郁之進(KATO, Ikunoshin)(JP/JP)</p> <p>〒520-21 滋賀県大津市瀬田3丁目4番1号</p> <p>寶酒造株式会社 中央研究所内 Shiga, (JP)</p>		特願平8/275231	1996年9月27日(27.09.96)	JP	特願平8/325900	1996年11月22日(22.11.96)	JP	特願平9/55434	1997年2月25日(25.02.97)	JP	特願平9/92866	1997年3月28日(28.03.97)	JP	特願平9/116045	1997年4月21日(21.04.97)	JP	<p>(74) 代理人 弁理士 安達光雄, 外(ADATI, Mituo et al.) 〒550 大阪府大阪市西区土佐堀1丁目6番20号 新栄ビル6階 Osaka, (JP)</p> <p>(81) 指定国 AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, GH, HU, IL, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZW, ARIPO特許 (GH, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧州特許 (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG).</p> <p>添付公開書類 国際調査報告書</p>
特願平8/275231	1996年9月27日(27.09.96)	JP															
特願平8/325900	1996年11月22日(22.11.96)	JP															
特願平9/55434	1997年2月25日(25.02.97)	JP															
特願平9/92866	1997年3月28日(28.03.97)	JP															
特願平9/116045	1997年4月21日(21.04.97)	JP															
<p>(54)Title: CYCLOPENTENONES, PROCESS FOR PREPARING THE SAME, AND THE USE THEREOF</p> <p>(54)発明の名称 シクロペンテノン類、その製造方法及び用途</p> <div style="text-align: center;">  <p>[1]</p> </div> <p>(57) Abstract</p> <p>A process for preparing 4,5-dihydroxy-2-cyclopenten-1-one represented by formula (1), characterized by heat-treating at least one member selected among: (a) uronic acids or uronic acid derivatives; (b) sugar compounds containing uronic acids and/or uronic acid derivatives; and (c) sugar compound-containing materials containing uronic acids and/or uronic acid derivatives.</p>																	

請求の範囲

1. 下記 (a)、(b)、(c) より選択される少なくとも1種の物を加熱処理することを特徴とする下記式【1】で表される4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンチン-1-オンの製造方法。

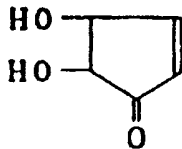
- (a) ウロノ酸又はウロノ酸誘導体、
 (b) ウロノ酸及び/又はウロノ酸誘導体を含有する糖化合物、
 (c) ウロノ酸及び/又はウロノ酸誘導体を含有する糖化合物含有物。



【1】

2. 下記 (a)、(b)、(c) より選択される少なくとも1種の物を加熱処理し、次いで該加熱処理物より式【1】で表される4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンチン-1-オンを採取することを特徴とする4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンチン-1-オンの製造方法。

- (a) ウロノ酸又はウロノ酸誘導体、
 (b) ウロノ酸及び/又はウロノ酸誘導体を含有する糖化合物、
 (c) ウロノ酸及び/又はウロノ酸誘導体を含有する糖化合物含有物。



【1】

3. ウロノ酸がガラクトン酸、グルクロン酸、グルロン酸、マンノロン酸及び/又はイヌロン酸である請求の範囲1又は2記載の4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンチン-1-オンの製造方法。

4. ウロノ酸誘導体が、ウロノ酸の塩、あるいはウロノ酸ラクトン、ウロノ酸

エステル、ウロン酸アミド又はそれらの塩である請求の範囲 1 又は 2 記載の 4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オンの製造方法。

5. 糖化合物がペクチン、ペクチン酸、アルギン酸、ヒアルロン酸、ヘパリン、ヘパラン硫酸、フコイダン、コンドロイチン硫酸、コンドロイチン、デルマトン硫酸及び／又はその分解物から選択される糖化合物である請求の範囲 1 又は 2 記載の 4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オンの製造方法。

6. 加熱処理物が 60～350℃、数秒～数日加熱処理して得られる請求の範囲 1～5 のいずれか 1 項に記載の 4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オンの製造方法。

7. 加熱処理物が酸性～中性の条件下で加熱処理を行って得られる請求の範囲 1～6 のいずれか 1 項に記載の 4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オンの製造方法。

8. 下記工程を包含することを特徴とする 4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オンの光学活性体の製造方法。

(A) : (a)、(b)、(c) より選択される少なくとも 1 種の物を加熱処理し、4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オンを生成させる工程

(a) ウロン酸又はウロン酸誘導体、

(b) ウロン酸及び／又はウロン酸誘導体を含有する糖化合物、

(c) ウロン酸及び／又はウロン酸誘導体を含有する糖化合物含有物、

(B) : 必要に応じて、得られた加熱処理物より 4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オンを単離する工程、

(C) : 4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オンを光学分割する工程。

9. ウロン酸がガラクトロン酸、グルクロン酸、グルロン酸、マンヌロン酸及び／又はイズロン酸である請求の範囲 8 記載の 4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オンの光学活性体の製造方法。

10. ウロン酸誘導体が、ウロン酸の塩、あるいはウロン酸ラクトン、ウロン酸

エステル、ウロン酸アミド又はそれらの塩である請求の範囲 8 記載の 4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オンの光学活性体の製造方法。

11. 糖化合物がペクチン、ペクチン酸、アルギン酸、ヒアルロン酸、ヘパリン、ヘパラン硫酸、フコイダン、コンドロイチン硫酸、コンドロイチン、デルマトン硫酸及び／又はその分解物から選択される糖化合物である請求の範囲 8 記載の 4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オンの光学活性体の製造方法。

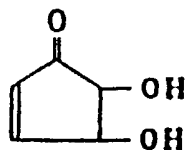
12. 加熱処理物が 60～350℃、数秒～数日加熱処理して得られる請求の範囲 8～11 のいずれか 1 項に記載の 4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オンの光学活性体の製造方法。

13. 加熱処理物が酸性～中性の条件下で加熱処理を行って得られる請求の範囲 8～12 のいずれか 1 項に記載の 4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オンの光学活性体の製造方法。

14. 旋光度が $[\alpha]_D^{20} - 10.5^\circ$ (≤ 0.30 , エタノール) である (－) 4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オン。

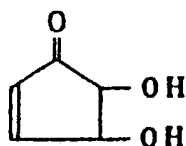
15. 旋光度が $[\alpha]_D^{20} + 10.4^\circ$ (≤ 0.53 , エタノール) である (+) 4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オン。

16. 式【1】で表される 4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オン及び／又はその光学活性体を含むことを特徴とする制がん剤。



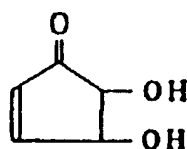
【1】

17. 式【1】で表される 4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オン及び／又はその光学活性体を含むことを特徴とするがん細胞分化誘導剤。



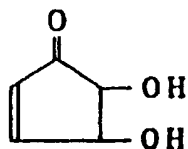
【 1 】

18. 式【 1 】で表される 4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オン及び／又はその光学活性体を含有することを特徴とするアポトーシス誘発剤。



【 1 】

19. 式【 1 】で表される 4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オン及び／又はその光学活性体を含有することを特徴とする抗菌剤。



【 1 】

- 20. 請求の範囲 1 9 記載の抗菌剤を有効成分とする防腐剤。
- 21. 請求の範囲 1 9 記載の抗菌剤を有効成分とする歯磨剤。
- 22. 請求の範囲 1 9 記載の抗菌剤を有効成分とする化粧料。
- 23. 請求の範囲 1 9 記載の抗菌剤を有効成分とする浴用剤。
- 24. 請求の範囲 1 記載の製造方法で得られる式【 1 】で表される 4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オンを有効成分として含有することを特徴とする請求の範囲 1 6 ～ 2 3 いずれか 1 項に記載の剤。
- 25. 請求の範囲 1 記載の加熱処理物を有効成分として含有することを特徴とする請求の範囲 1 6 ～ 2 3 いずれか 1 項に記載の剤。

26. 請求の範囲 2 記載の製造方法で採取される式【1】で表される 4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オンを有効成分として含有することを特徴とする請求の範囲 16~23 いずれか 1 項に記載の剤。

27. 式【1】で表される 4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オン及び／又はその光学活性体を有効成分として使用することを特徴とするがん細胞分化誘導方法。



28. 式【1】で表される 4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オン及び／又はその光学活性体を有効成分として使用することを特徴とするアポトーシス誘発方法。



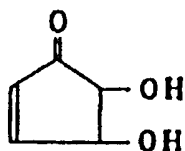
29. 請求の範囲 1 記載の製造方法で得られる式【1】で表される 4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オンを有効成分として使用することを特徴とする請求の範囲 27 又は 28 記載の方法。

30. 請求の範囲 1 記載の加熱処理物を有効成分として使用することを特徴とする請求の範囲 27 又は 28 に記載の方法。

31. 請求の範囲 2 記載の製造方法で採取される式【1】で表される 4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オンを有効成分として使用することを特徴とする請求の範囲 27 又は 28 に記載の方法。

32. 式【1】で表される 4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オ

ン及び／又はその光学活性体を含有、希釈及び／又は添加してなることを特徴とする食品又は飲料。



【1】

33. 請求の範囲1記載の製造方法で得られる式【1】で表される4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オンを含有、希釈及び／又は添加してなることを特徴とする請求の範囲32記載の食品又は飲料。

34. 請求の範囲1記載の加熱処理物を含有、希釈及び／又は添加してなることを特徴とする請求の範囲32記載の食品又は飲料。

35. 請求の範囲2記載の製造方法で採取される式【1】で表される4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オンを含有、希釈及び／又は添加してなることを特徴とする請求の範囲32記載の食品又は飲料。

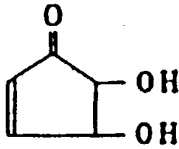
36. 式【1】で表される4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オン及び／又はその光学活性体を100重量部当り 5×10^{-6} 重量部以上含有することを特徴とする請求の範囲32～35いずれか1項に記載の食品又は飲料。

37. 制がん性食品又は制がん性飲料である請求の範囲32～36いずれか1項に記載の食品又は飲料。

38. 抗菌性食品又は抗菌性飲料である請求の範囲32～36いずれか1項に記載の食品又は飲料。

39. ウロン酸及び／又はウロン酸誘導体を含有する糖化合物含有物中のウロン酸、ウロン酸誘導体、式【1】で表される4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オンの生成中間体、又は式【1】で表される4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オンと反応性を有するアミン類、アミノ酸類、ペプチド類又は蛋白質の反応性の少なくとも一部が消失した及び／又は該反応性物質の少なくとも一部が除去されたものであるウロン酸及び／又はウロン酸誘導体を

含有する糖化合物含有物。



【1】

40. 乾式加熱処理されて、ウロン酸、ウロン酸誘導体、式【1】で表される4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オンの生成中間体、又は式【1】で表される4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オンと反応性を有するアミン類、アミノ酸類、ペプチド類又は蛋白質の反応性の少なくとも一部が消失した及び／又は該反応性物質の少なくとも一部が除去されたものである請求の範囲39記載のウロン酸及び／又はウロン酸誘導体を含有する糖化合物含有物。

41. 乾式加熱処理が、ウロン酸及び／又はウロン酸誘導体を含有する糖化合物含有物を60～400℃の熱風で数秒から数日の焙炒処理を行うものである請求の範囲40記載のウロン酸及び／又はウロン酸誘導体を含有する糖化合物含有物。

42. ウロン酸及び／又はウロン酸誘導体を含有する糖化合物含有物が焙炒植物、焙炒動物又は焙炒微生物から選択される請求の範囲41記載のウロン酸及び／又はウロン酸誘導体を含有する糖化合物含有物。

43. ウロン酸及び／又はウロン酸誘導体を含有する糖化合物含有物が焙炒野菜、焙炒果物、焙炒穀物、焙炒きのこ、焙炒海藻、焙炒皮質又は焙炒軟骨から選択される請求の範囲42記載のウロン酸及び／又はウロン酸誘導体を含有する糖化合物含有物。

44. 蛋白分解酵素処理されて、ウロン酸、ウロン酸誘導体、式【1】で表される4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オンの生成中間体、又は式【1】で表される4, 5-ジヒドロキシ-2-シクロペンテン-1-オンと反応性を有するアミン類、アミノ酸類、ペプチド類又は蛋白質の反応性の少なくとも